

米国タイオガ社とライセンス契約を締結

当社は本年9月、タイオガ社が過敏性腸症候群の治療剤として米国で開発中のアシマドリン(一般名)を、日本・韓国・台湾で独占的に開発・販売する権利を取得しました。

今回の契約締結により、当社はタイオガ社に対し契約一時金を支払うとともに、今後、同剤の開発進捗に応じたマイルストーンを支払います。また、上市後は販売額の目標達成に応じたマイルストーンおよび売上高に応じたロイヤリティを支払います。

過敏性腸症候群は、緊張や不安、ストレス、不規則な生活などが原因で腸が過敏になり、腹痛や腹部不快感、便通異常などの症状を引き起こす疾患で、その症状から、下痢型、便秘型、下痢と便秘を繰り返す交替型に分類されます。アシマドリンは経口投与が可能な低分子化合物で、3種類あるオピオイド受容体(μ 、 κ 、 δ)のうち消化管の痛みや運動に関与していると言われる κ 受容体に選択的に作用し、腹痛をはじめとする種々の腹部症状を改善する薬剤です。

過敏性腸症候群の患者さん(約600名)を対象に米国で実施されたフェーズIIb試験では、ア

シマドリンは中等度以上の腹痛を訴える下痢型の過敏性腸症候群の患者さんの腹痛・腹部不快感、便意切迫感を改善し排便回数を減少させるなど、統計学的にも有意な治療効果を示しています。また、これまでに安全性上、特に問題となるような有害事象は認められていません。

なお、タイオガ社は2010年の第1四半期に米国でフェーズIII試験を開始する予定です。また、当社も2010年の第2四半期に国内においてフェーズI試験を開始する予定です。

(参考)

タイオガ社について

タイオガ社は、米国カリフォルニア州サンディエゴ市に拠点を置く消化器領域の革新的治療薬の開発を専門とするバイオ医薬品会社で、2005年にライフサイエンス企業を主な投資先とするフォワードベンチャー社によって設立されました。

独エボテック社とイオンチャネルに関する創薬について提携

当社とエボテック社は昨年3月にプロテアーゼを標的とした創薬について提携し、同社が有するフラグメント創薬技術を利用してプロテアーゼの働きを阻害する低分子化合物の創製に取り組んでいますが、今般(本年10月)、エボテック社とイオンチャネル¹⁾を標的とした新たな創薬提携契約を締結しました。

今回の創薬提携では、エボテック社が有する独自の蛍光スクリーニング法²⁾とイオンチャネルに関する創薬基盤を用いて、当社が選定したイオンチャネルを創薬標的とした低分子化合物の創製を目指します。

当社は、今回の契約締結により、今後1年半をめぐりにエボテック社に研究資金を投入するとともに、創薬の進捗に応じた成功報酬を支払います。

なお、提携研究から創製された化合物については、当社が世界的に開発・販売する権利を有しています。

(参考)

エボテック社について

エボテック社は、広範囲にわたる創薬基盤技術を有するベンチャーで、独自の高感度スクリーニング技術や蛋白質X線結晶構造解析、フラグメントライブラリーなどを組み合わせ、治療上有用な医薬品候補化合物を創製しています。なお、同社の技術は高く評価されており、多くの製薬企業やバイオテクノロジー企業との提携実績があります。

1)イオンチャネル

イオンチャネルは、細胞の内外へ様々なイオン物質を通過させる膜蛋白質で、全ての細胞の機能を調整しています。イオンチャネルは、循環器疾患、神経疾患、泌尿器疾患、代謝性疾患、炎症性疾患を含めた種々の疾患に関与しており、イオンチャネルが潜在的に有望な創薬標的であることは広く知られています。

2)蛍光スクリーニング法

蛍光スクリーニング法とは、特定の生体分子に作用する化合物の活性を蛍光反応として捉えて評価するスクリーニングの手法です。イオンチャネルを対象とした創薬においては、電位変化や電流量を測定する電気生理学的な手法が一般的ですが、蛍光スクリーニング法は電気生理学的な手法に比べて評価速度が速いことが特長です。エボテック社は、特定のイオンチャネルに関して高感度の蛍光スクリーニング法を開発しています。

経口2型糖尿病治療薬

グラクティブ[®]錠の製造販売承認を取得

当社は、2007年12月に承認申請していました経口2型糖尿病治療薬「グラクティブ[®]錠」（一般名：シタグリブチンリン酸塩水和物）について、本年10月16日付で製造販売承認を取得しました。

なお、本剤は2004年11月に締結された当社とMerck & Co., Inc., Whitehouse Station, NJ., U.S.A.とのライセンス契約に基づき、当社と万有製薬株式会社が国内共同開発したものです。

2型糖尿病は、インスリンを十分に産生・分泌できなかつたり、産生されたインスリンが十分に機能しなかつたり、また、生体がグルコースを生成し過ぎることによって起こる慢性の高血糖を主徴とする代謝疾患です。国内における糖尿病患者は年々増加傾向にあり、最近の調査によると、糖尿病が強く疑われる人は約890万人にもものぼるとの報告もあります。

グラクティブ[®]錠は、Merck & Co., Inc., Whitehouse Station, NJ., U.S.A.により創製されたDPP-4(ジペプチジルペプチターゼ-4)の選択的阻害剤で、血糖値を下げる生体内の仕組み(インクレチンシステム)を活性化することにより血糖値をコントロールします。

インクレチンは食事の摂取などにより消化管で産生されるホルモンで、血糖値が高値の時はインスリン分泌を増強し、血糖値が正常あるいは低値の時はインスリン分泌を増強しないという特徴を有します。また、グルカゴンの分泌を低下させ肝臓における糖の新生を抑制します。

グラクティブ[®]錠は、このインクレチンを分解する酵素であるDPP-4を選択的に阻害することにより、血糖値依存的にインスリン分泌を増強して血糖低下作用を発揮する全く新しい作用機序を持った経口糖尿病治療薬です。

また、1日1回投与で、且つ、食事の影響を受けないことから、食前・食後のいずれにおいても服用可能な薬剤です。

なお、海外ではMerck & Co., Inc., Whitehouse Station, NJ., U.S.A.が2006年8月に世界初のDPP-4阻害剤として本剤を発売し、現在は世界85カ国以上で承認され、これまでに米国だけでも1,600万人以上の患者さんに処方されています。

注) 国内共同販売先の万有製薬は同剤を「ジャヌビア[®]錠」の製品名で販売いたします。

イメンド®カプセルの製造販売承認を取得

当社は、2007年7月に承認申請していました選択的ニューロキニン1 (NK1) 受容体拮抗型制吐剤「イメンド®カプセル」(一般名：アプレピタント)について、本年10月16日付で製造販売承認を取得しました。

なお、本剤は2004年11月に締結された当社と Merck & Co., Inc., Whitehouse Station, NJ., U.S.A.とのライセンス契約に基づき、当社が国内単独開発したものです。

がん患者さんにとって抗悪性腫瘍剤の投与に伴う悪心・嘔吐は最も苦痛を感じる副作用の一つです。

悪心・嘔吐を予防できず、当該症状を繰り返すと、身体的には低栄養や体重減少から全身状態が悪化したり、体力消耗状態に陥ったりします。また、悪心・嘔吐の不快感など心理的な影響からQOLの低下を招くなど、化学療法の継続に支障を来すことも少なくありません。

したがって、抗悪性腫瘍剤の投与に伴う悪心・嘔吐の予防および症状の軽減は、がん患者さんのQOLの維持、さらには化学療法を継続する上で極めて重要といわれています。

また、がん化学療法に伴う悪心・嘔吐には、

抗悪性腫瘍剤投与開始後24時間以内に発生する急性嘔吐と、抗悪性腫瘍剤投与開始後24時間以降に発生する遅発性嘔吐がありますが、日本においては特に遅発性嘔吐に対して有効性が確立された治療薬がないのが現状です。

イメンド®は、Merck & Co., Inc., Whitehouse Station, NJ., U.S.A.により創製された世界初の選択的ニューロキニン1 (NK1) 受容体拮抗型制吐剤で、これまでの国内外の臨床試験成績から、急性期のみならず既存治療では効果が不十分であった遅発期の悪心・嘔吐に対しても有効な薬剤であることが確認されており、今回、日本でも本剤の製造販売承認が得られたことで、いまだ抗悪性腫瘍剤の投与に伴う悪心・嘔吐で苦しんでおられる患者さんに新たな治療の選択肢を提供できることとなります。

なお、イメンド®は現在、米国・EU諸国を含め世界70カ国以上で承認・販売されており、米国臨床腫瘍学会 (ASCO)、国際癌支持療法学会 (MASCC) および米国国立包括癌ネットワーク (NCCN) などが公表する制吐療法ガイドラインで抗悪性腫瘍剤投与に伴う悪心・嘔吐の予防薬として本剤の使用が推奨されています。